



SCHWEIZERISCHE EIDGENÖSSENSCHAFT

EIDGENÖSSISCHES AMT FÜR GEISTIGES EIGENTUM

v

Internationale Klassifikation: C 07 d 29/00

C 07 d 51/62

Gesuchsnummer: 113/69
(Teilgesuch von 10769/65)

Anmeldungsdatum: 24. Juni 1966, 19 Uhr

Patent erteilt: 30. Juni 1969

Patentschrift veröffentlicht: 15. August 1969

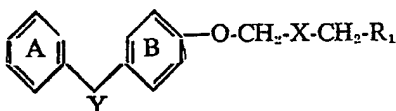
HAUPTPATENT

F. Hoffmann-La Roche & Co. Aktiengesellschaft

Verfahren zur Herstellung von aromatischen Äthern

Dr. Albrecht Edenhofer, Riehen, Dr. Henri Ramuz, Birsfelden, und Dr. Hans Spiegelberg, Basel, sind als Erfinder genannt worden

1 Die vorliegende Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von aromatischen Äthern der Formel

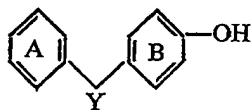


oder von in den aromatischen Ringen A und B durch eine oder mehrere Alkyl-, Alkoxy-, Halogen-, Cyano-, Carboxy-, Nitro-, Amino- oder Trifluormethylgruppen substituierten Derivaten davon, in welcher Formel R₁ einen über Stickstoff mit der Methylengruppe verbundenen ganz oder teilweise hydrierten, gegebenenfalls hydroxy-substituierten Pyridin- oder Pyrazinrest darstellt, der in p-Stellung mit einem gegebenenfalls durch eine oder mehrere Alkyl-, Alkoxy-, Halogen- oder Trifluormethylgruppen substituierten Phenylrest verknüpft ist, X eine Carbonyl- oder Hydroxymethylengruppe bedeutet und Y eine Carbonyl-, Methylene- oder Hydroxymethylengruppe bezeichnet, sowie von Ketalen und Säureadditionssalzen dieser Verbindungen.

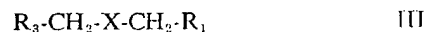
Die vorstehend erwähnten Alkylgruppen sind vorzugsweise niedere Alkylgruppen mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen, wie Methyl, Äthyl, Isopropyl. Auch die Alkoxygruppen enthalten vorzugsweise bis zu 5 Kohlenstoffatome, wie Methoxy, Äthoxy. Von den Halogenatomen sind Fluor, Chlor und Brom bevorzugt. Vorhandene Oxogruppen können durch niedere Alkanole oder Glykole, beispielsweise durch Methylalkohol oder Äthylenglykol ketalisiert sein.

Die Pyridin- und Pyrazinreste sind ganz oder teilweise hydriert. Geeignete Reste sind z.B. der Dihydropyridin-, Tetrahydropyridin-, Piperidin-, Dihydropyrazin-, Tetrahydropyrazin- und Piperazinrest.

Das erfindungsgemässe Verfahren ist dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel



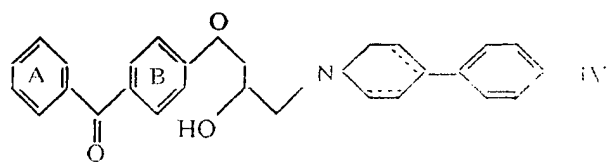
2 in der die aromatischen Ringe A und B, wie oben angegeben, substituiert sein können, Y eine Carbonyl-, Methylene- oder Hydroxymethylene-Gruppe bezeichnet, oder, falls Y eine Carbonylgruppe bezeichnet, ein Ketal dieser Verbindung mit einer Verbindung der Formel



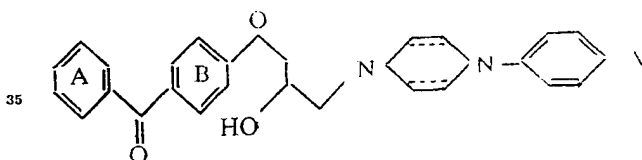
10 in der X eine Carbonyl- oder Hydroxymethylengruppe bezeichnet, R₃ Halogen, Alkyl- bzw. Arylsulfonyloxy bedeutet oder R₃ und X zusammen mit der endständigen Methylengruppe den Rest $-CH-CH_2-O$ darstellen, umsetzt.

15 Bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, in der X eine Hydroxymethylengruppe und Y eine Carbonylgruppe darstellt.

Verbindungen der Formel



25 oder der Formel



II 40 in denen die gestrichelten Bindungen hydriert und der aromatische Ring A und/oder der Phenylrest durch Halogen substituiert sein können, nehmen eine Vorzugsstellung ein. Folgende durch die Formeln IV und V